

PCT

国際事務局

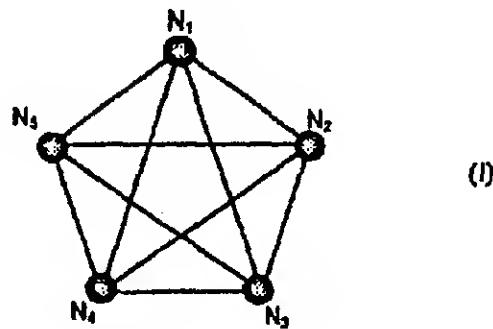


特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(51) 国際特許分類7 C07C 69/73, 69/767, 205/49, 229/00, 233/01, 251/32, 255/49, 311/02, 317/00, 321/24, C07K 7/06, C07D 207/08, 207/10, 207/32, 209/18, 209/42, 213/30, 213/64, 235/26, 241/08, 277/60, 401/14, A61K 31/18, 31/216, 31/277, 31/40, 31/415, 31/428, 31/44, 31/495, 38/08, A61P 19/02, 37/06, 43/00	A1	(11) 国際公開番号 WO00/27792 (43) 国際公開日 2000年5月18日(18.05.00)
(21) 国際出願番号 PCT/JP99/06166		小坪弘典(KOTSUBO, Hironori)[JP/JP]
(22) 国際出願日 1999年11月5日(05.11.99)		〒930-0224 富山県中新川郡立山町西芦原44-7 Toyama, (JP)
(30) 優先権データ 特願平10/328792 特願平11/80693	JP JP	相川幸彦(AIKA WA, Yukihiko)[JP/JP] 〒939-0521 富山県富山市水橋中村町230 Toyama, (JP) 広野修一(HIRONO, Shuichi)[JP/JP] 〒175-0093 東京都板橋区赤塚新町3丁目16-29 Tokyo, (JP) 塩澤俊一(SHIOZAWA, Shunichi)[JP/JP] 〒651-2274 兵庫県神戸市西区竹の台2丁目11-6 Hyogo, (JP)
出願人(米国を除くすべての指定国について) ・化学工業株式会社 ・YAMA CHEMICAL CO., LTD. [JP/JP] 60-0023 東京都新宿区西新宿3丁目2-5 Tokyo, (JP)		(81) 指定国 AE, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW, 歐州特許(AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI特許(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG), ARIPO特許(GH, GM, KE, LS, MW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), ユーラシア特許(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM)
発明者; および 発明者/出願人(米国についてのみ) ・大久晃(CHAKI, Hisaaki)[JP/JP] 30-1328 富山県上新川郡大山町小原屋455-1 Toyama, (JP)		添付公開書類 国際調査報告書
・忠和(TAKAKURA, Tadakazu)[JP/JP] 39-8073 富山県富山市大町26-2 Toyama, (JP)		
・圭一(TSUCHIDA, Keiichi)[JP/JP] 39-2701 富山県婦負郡婦中町西本郷427-23 Toyama, (JP)		
・潤一(YOKOTANI, Junichi)[JP/JP] 30-0817 富山県富山市下奥井1-6-27 Toyama, (JP)		

)Title: NOVEL COMPOUNDS AND MEDICINAL USE THEREOF

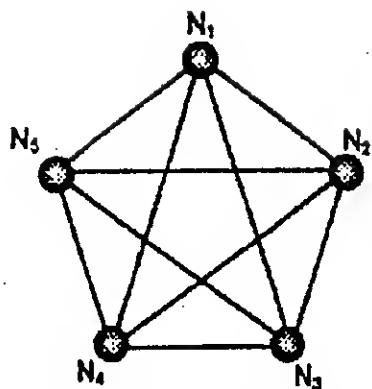
)発明の名称 新規化合物およびその医薬用途



(57) Abstract

Compounds represented by formula (I) wherein N₁ represents an atom to which a donor hydrogen atom in a hydrogen bond donor group is bonded or a hydrogen bond acceptor atom in a hydrogen bond acceptor group; N₃ represents a hydrogen bond acceptor atom in a hydrogen bond acceptor group; and N₂, N₄ and N₅ represent each an arbitrary carbon atom constituting a hydrophobic group; having an atom corresponding to N₁ and atoms corresponding to at least two atoms selected from N₁, N₂, N₃, N₄ and N₅, among the five atoms constituting a pharmacophore specified by the interatomic distances among N₁, N₂, N₃, N₄ and N₅; and, in the optimized stereochemical structure thereof, interatomic distances between the atom corresponding to N₃ and atoms corresponding to at least two atoms selected from N₁, N₂, N₄ and N₅ within the scope of the pharmacophore interatomic distance, or salts thereof. Because of having an effect of inhibiting the activity of a p53 transcription factor AP-1, these compounds are useful as preventives/remedies for diseases in which the excessive expression of AP-1 increases and as AP-1 inhibitors.

式



「式中、N₁は、水素結合供与基中の供与性水素原子が結合した原子または水素結合受容基中の水素結合受容原子を；N₃は、水素結合受容基中の水素結合受容原子を；N₂、N₄およびN₅は、疎水性基を構成する任意の炭素原子を示す」で表され、かつ、N₁、N₂、N₃、N₄およびN₅の原子間の距離で規定されるファーマコフォー(pharmacophore)を構成する5つの原子のうち、N₃に対応する原子およびN₁、N₂、N₄またはN₅から選ばれる2つ以上の原子に対応する原子を有する化合物であり、かつ、その最適化された立体構造において、N₃に対応する原子およびN₁、N₂、N₄またはN₅から選ばれる2つ以上の原子間の距離がファーマコフォーの原子間の距離にある化合物またはその塩は、転写因子A P-1の活性阻害作用を有し、A P-1の過剰発現が関与する疾患の予防・治療剤およびA P-1阻害剤として有用である。

PCTに基づいて公開される国際出願のパンフレット第一頁に掲載されたPCT加盟国を同定するために使用されるコード(参考情報)

AE アラブ首長国連邦	DM ドミニカ	KZ カザフスタン	RU ロシア
AL アルバニア	EE エストニア	LC セントルシア	SD スーダン
AM アルメニア	ES スペイン	L1 リヒテンシュタイン	SE スウェーデン
AT オーストリア	FI フィンランド	LK スリ・ランカ	SG シンガポール
AU オーストラリア	FR フランス	LR リベリア	S1 スロヴェニア
AZ アゼルバイジャン	GA ガボン	LS レソト	SK スロヴァキア
BA ボスニア・ヘルツェゴビナ	GB 英国	LT リトアニア	SL シエラ・レオネ
BB バルバドス	GD グレナダ	LU ルクセンブルグ	SN セネガル
BE ベルギー	GE グルジア	LV ラトヴィア	SZ スウェーデン
BF ブルガリア、ファソ	GH ガーナ	MA モロッコ	TD ティード
BG ブルガリア	GM ガンビア	MC モナコ	TG トーゴー
BJ ベナン	GN ギニア	MD モルドヴァ	TJ タジキスタン
BR ブラジル	GW ギニア・ビサオ	MG マダガスカル	TZ タンザニア
BY ベラルーシ	GR ギリシャ	MK マケドニア田ユーロスラヴィア	TM トルクメニスタン
CA カナダ	HR クロアチア	共和国	TR トルコ
CF 中央アフリカ	HU ハンガリー	ML マリ	TT トリニダッド・トバゴ
CG コンゴ	ID インドネシア	MN モンゴル	UA ウクライナ
CH スイス	IE アイルランド	MR モーリタニア	UG ウガンダ
CI コートジボアール	IL イスラエル	MW マラウイ	US 米国
CM カメルーン	IN インド	MX メキシコ	UZ ウズベキスタン
CN 中国	IS アイスランド	NE ニジェール	VN ヴィエトナム
CR コスタ・リカ	IT イタリア	NL オランダ	YU ユーロースラビア
CU キューバ	JP 日本	NO ノルウェー	ZA 南アフリカ共和国
CY キプロス	KE ケニア	NZ ニュー・ジーランド	ZW ジンバブエ
CZ チェコ	KG キルギスタン	PL ポーランド	
DE ドイツ	KP 北朝鮮	PT ポルトガル	
DK デンマーク	KR 韓国	RO ルーマニア	